

特 許 協 力 条 約

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

REC'D 17 JUN 2004

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 FP03-0198-00	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。		
国際出願番号 PCT/JPO3/10092	国際出願日 (日.月.年) 07.08.2003	優先日 (日.月.年) 28.08.2002	
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ A61K47/32, 9/70, 31/405, 31/4422, 31/48, 47/06, 47/12			
出願人 (氏名又は名称) 久光製薬株式会社			

- 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
- この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 5 ページからなる。
☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)
この附属書類は、全部で ページである。
- この国際予備審査報告は、次の内容を含む。
 - ☒ 国際予備審査報告の基礎
 - ☐ 優先権
 - ☐ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
 - ☐ 発明の単一性の欠如
 - ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
 - ☐ ある種の引用文献
 - ☐ 国際出願の不備
 - ☒ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 04.12.2003	国際予備審査報告を作成した日 20.05.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員)	4C	3127
	川口 裕美子 電話番号 03-3581-1101 内線 3451		

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-6	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-6	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-6	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1: JP 9-315957 A (久光製薬株式会社) 1997.12.09
 文献2: EP 993829 A1 (Hisamitsu Pharm. Co., Inc.) 2000.04.19
 文献3: WO 96/40139 A1 (ALZA CORPORATION) 1996.12.19
 文献4: JP 2002-515424 A (シュバルツ ファルマ アクチエンゲゼルシャフト), 2002.05.28
 文献5: WO 02/38139 A1 (久光製薬株式会社) 2002.05.16
 文献6: JP 4-368323 A (積水化学工業株式会社) 1992.12.21

*請求の範囲1、2、5、6

請求の範囲1、2、5、6に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1、2、5、6より進歩性を有しない。

文献1には、スチレン-イソプレネ-スチレンブロック共重合体、アクリル酸-2-エチルヘキシル/酢酸ビニル共重合体、脂環族飽和炭化水素樹脂を含有する感圧性接着剤層を支持体上に有し、有効成分としてエストラジオール及び酢酸ノルエチステロンを含有する経皮治療用装置が（実施例1参照）、文献2には、スチレン-イソプレネ-スチレンブロック共重合体、アクリル酸-2-エチルヘキシル/酢酸ビニル共重合体、脂環族飽和炭化水素樹脂を含有する感圧性接着剤層を支持体上に有し、有効成分としてセロトニン受容体拮抗薬を含有する経皮治療用装置が記載されている（実施例1参照）。

請求の範囲1、2、5、6に係る発明と文献1、2に記載の発明とを対比するに、請求の範囲1、2、5、6に係る発明においては、塩基性窒素を含有し且つ自己粘着性を有さない塩基性窒素含有高分子が添加されているのに対し、文献1、2に記載の製剤には前記高分子が含有されていない点で両発明は相違している。

しかしながら、文献1、2には、経皮治療用装置に吸収促進剤を添加可能である旨記載されており（文献1【0014】及び文献2【0013】参照）、文献5には、請求の範囲3に係る発明において特定された高分子が薬物の経皮吸収性を改善する旨も記載されているのであるから、文献1において吸収促進剤として文献5に記載の前記高分子を採用してみること、当業者が格別の技術的創意を要したとは認められない。また、前記高分子を添加したことによる効果についても、経皮吸収性だけでなく、粘着剤の凝集性を改善することが文献6に記載されているのであるから、請求の範囲1、2、5、6に係る発明の効果は、当業者の予測の範囲内であるといえる。

Ⅷ. 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1 は、明細書によって十分に裏付けされていない。

請求の範囲 1 に記載された「塩基性窒素を含有し且つ自己粘着性を有さない塩基性窒素含有高分子」なる文言は、明細書の記載を検討しても、明細書に具体例として記載されたメタアクリル酸メチル・メタアクリル酸ブチル・メタアクリル酸ジメチルアミノエチル共重合体等のアクリル系の高分子以外に、具体的にいかなる高分子を包含し、また、包含しないかが明確でない。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V 欄の続き

*請求の範囲 3、4

請求の範囲 3、4に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 1-6 より進歩性を有しない。

請求の範囲 3、4に係る発明は、請求の範囲 1に係る発明の製剤に含まれる薬物について、請求の範囲 3に係る発明においては水に対する溶解度を、請求の範囲 4に係る発明においてはペルゴリド等の薬物に特定したものであるが、文献 1、2に記載の経皮治療用装置には請求の範囲 3、4において特定された薬物が添加されていない点で両発明は相違する。

しかしながら文献 1には、文献 1に記載の経皮治療用装置の有効成分として、公知の薬物を選択可能である旨記載されており (【0010】参照)、文献 3-6に記載されているように、請求の範囲 3、4において特定された薬物は経皮投与に用いられる公知の薬物なのであるから、ペルゴリド等の経皮投与のための剤形として文献 1、2のものを採用してみることとは当業者が容易になし得たことである。

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2003/010092



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference FP03-0198-00	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/JP2003/010092	International filing date (day/month/year) 07 August 2003 (07.08.2003)	Priority date (day/month/year) 28 August 2002 (28.08.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 47/32, 9/70, 31/405, 31/4422, 31/48, 47/06, 47/12		
Applicant HISAMITSU PHARMACEUTICAL CO., INC.		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☒ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 04 December 2003 (04.12.2003)	Date of completion of this report 20 May 2004 (20.05.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2003/010092

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item. These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP 03/10092

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-6	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-6	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-6	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1: JP 9-315957 A (Hisamitsu Pharm. Co., Inc.),
09 December 1997

Document 2: EP 993829 A1 (Hisamitsu Pharm. Co., Inc.),
19 April 2000

Document 3: WO 96/40139 A1 (Alza Corp.), 19 December
1996

Document 4: JP 2002-515424 A (Schwarz Pharma AG), 28 May
2002

Document 5: WO 02/38139 A1 (Hisamitsu Pharm. Co., Inc.),
16 May 2002

Document 6: JP 4-368323 A (Sekisui Chemical Co., Ltd.),
21 December 1992

Claims 1, 2, 5 and 6

The invention that is set forth in claims 1, 2, 5 and 6 does not involve an inventive step in the light of documents 1, 2, 5 and 6 cited in the international search report.

Document 1 discloses an apparatus for percutaneous therapy that comprises estradiol and norethisterone acetate as active components, wherein said apparatus is configured from a pressure-sensitive adhesive layer containing a styrene-isoprene-styrene block copolymer, an acrylic acid-2-ethylhexyl/vinyl acetate copolymer and a

saturated cycloaliphatic hydrocarbon resin, which is disposed upon a support (refer to example 1), and document 2 discloses an apparatus for percutaneous therapy that comprises a serotonin receptor antagonizing agent as an active component, wherein said apparatus is configured from a pressure-sensitive adhesive layer containing a styrene-isoprene-styrene block copolymer, an acrylic acid-2-ethylhexyl/vinyl acetate copolymer and a saturated cycloaliphatic hydrocarbon resin, which is disposed upon a support (refer to example 1).

A comparison of the invention that is set forth in claims 1, 2, 5 and 6 and the inventions that are disclosed in documents 1 and 2 shows that a basic nitrogen-containing polymer that comprises basic nitrogen and does not exhibit a self-adhesion property is added to the invention that are is forth in claims 1, 2, 5 and 6, whereas the preparations that are disclosed in documents 1 and 2 do not contain the aforementioned polymer; therefore, these inventions are different.

However, documents 1 and 2 indicate that it is possible to add an absorption promoting agent to the apparatuses for percutaneous therapy (refer to document 1, paragraph [0014] and document 2, paragraph [0013]), and document 5 indicates that the polymers specified in claim 3 improve the percutaneous absorption characteristics of a medicament; therefore, it is not considered to require special creativity for a person skilled in the art to attempt to employ the aforementioned polymers that are disclosed in document 5 as the absorption promoting agent in the invention that is disclosed in document 1. In addition, document 6 indicates that not only the percutaneous absorption characteristics but also the cohesion characteristics of the adhesive agent are improved via the addition of the aforementioned polymers; therefore, it can be said that the effects exhibited by

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP 03/10092

the invention that is set forth in claims 1, 2, 5 and 6 could have been predicted by a person skilled in the art.

Claims 3 and 4

The invention that is set forth in claims 3 and 4 does not involve an inventive step in the light of documents 1-6 cited in the international search report.

The invention that is set forth in claims 3 and 4 pertains to the medicament in the preparation from the invention that is set forth in claim 1, with claim 3 specifying the level of solubility of the medicament in relation to water and claim 4 specifying medicaments such as pergolide for use in the invention, whereas the medicaments that are specified in claims 3 and 4 are not added to the apparatuses for percutaneous therapy that are disclosed in documents 1 and 2; therefore, these inventions are different.

However, document 1 indicates that it is possible to select a well-known medicament as the active component for the apparatus for percutaneous therapy that is disclosed therein (refer to paragraph [0010]), and the medicaments that are set forth in claims 3 and 4 are well-known medicaments which can be administered percutaneously, as disclosed in documents 3-6; therefore, it would be easy for a person skilled in the art to attempt to employ the dosage form that is disclosed in document 1 or document 2 as the dosage form for the percutaneous administration of pergolide or the like.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.
PCT/JP 03/10092

VIII. Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

Claim 1 is not fully supported by the description.

With regards to the statement "basic nitrogen-containing polymer that comprises basic nitrogen and does not exhibit a self-adhesion property," as set forth in claim 1, even with consideration of the description it is unclear specifically what polymers other than the acrylic polymers such as methyl methacrylate copolymers, butyl methacrylate copolymers and dimethylaminoethyl methacrylate copolymers that are presented as examples in the description are included in the scope of said disclosure, and what polymers are not included in the scope of said disclosure.